



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **WZB117**
CAS 号: **1223397-11-2**
产品货号: **S88006**

生物活性:				
Description	WZB117 是一种葡萄糖转运蛋白 1 (Glut1) 抑制剂, 可下调糖酵解, 诱导细胞周期停滞, 并在体内外抑制癌细胞生长。			
IC50 & Target[1]	GLUT1			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HEK293	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of the Glucose Transporter (GLUT1, SLC2A1) as assessed by a FRET based flow cytometry assay using a genetically-encoded biosensor for measuring free glucose (FLII12Pglu-700uDelta6) in HEK293 JumpIN TRex SLC2A1 WT-OE cells
	HEK293	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of the Glucose Transporter (GLUT2, SLC2A2) as assessed by a FRET based flow cytometry assay using a genetically-encoded biosensor for measuring free glucose (FLII12Pglu-700uDelta6) in HEK293 JumpIN TRex SLC2A2 WT-OE cells
	HEK293	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of the Glucose Transporter (GLUT3, SLC2A3) as assessed by a FRET based flow cytometry assay using a genetically-encoded biosensor for measuring free glucose (FLII12Pglu-700uDelta6) in HEK293 JumpIN TRex SLC2A3 WT-OE cells
	HEK293	IC ₅₀	2.5 μM	Inhibition of the Glucose Transporter (GLUT4, SLC2A4) as assessed by a FRET based flow cytometry assay using a genetically-encoded biosensor for measuring free glucose (FLII12Pglu-700uDelta6) in HEK293 JumpIN TRex SLC2A4 WT-OE cells
	NCI-H1299	IC ₅₀	20.4 μM	Cytotoxicity against human H1299 cells assessed as growth inhibition after 48 hrs by MTT assay
In Vitro	WZB117 抑制癌细胞的葡萄糖转运呈剂量依赖性; 该作用在实验开始后 1 分钟内发生, 提示其通过直接快速机制发挥作用。细胞活力检测显示, WZB117 抑制癌细胞增殖的 IC50 约为 10 μM。克隆形成实验表明其对癌细胞的抑制作用不可逆。WZB117 对肺癌 A549 细胞的抑制作用显著强于非肿瘤性 NL20 细胞, 在乳腺癌 MCF7 细胞和非肿瘤性 MCF12A 细胞中观察到类似结果; 在缺氧条件下, WZB117 对癌细胞的生长抑制作用更明显[1].			
In Vivo	动物研究显示, 每日腹腔内注射 10 mg/kg 体重的 WZB117 后, 化合物治疗的肿瘤大小平均比模拟(PBS/DMSO)治疗的肿瘤小 70% 以上。值得注意的是, 10 个化合物治疗的肿瘤中有 2 个在治疗期间消失, 即使在研究结束时也从未再生长。体重测量和分析显示, 与模拟治疗的小鼠相比, 用 WZB117 治疗的小鼠体重减轻了约 1 至 2 克, 大部分体重减轻在脂肪组织中。研究结束时对小鼠的血细胞计数和分析表明, 与载体治疗的小鼠相比, 化合物治疗的小鼠的淋巴细胞和血小板发生了变化, 但细胞计数仍在正常范围内。使用葡萄糖转运抑制剂的担忧是该抑制剂可能会在治疗的小鼠中产生高血糖症[1]。			
细胞实验:				



Solvent&Solubility	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (678.78 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Solvent Mass Concentration Preparing Stock Solutions		1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.7151 mL	13.5755 mL	27.1510 mL
		5 mM	0.5430 mL	2.7151 mL	5.4302 mL
		10 mM	0.2715 mL	1.3576 mL	2.7151 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐盐水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。					
参考文献	[1]. Liu Y, et al. A small-molecule inhibitor of glucose transporter 1 downregulates glycolysis, induces cell-cycle arrest, and inhibits cancer cell growth in vitro and in vivo. Mol Cancer Ther. 2012 Aug;11(8):1672-82.				



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month. -80° C 储存时,请在 6 个月内使用, -20° C 储存时,请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.7151 mL	13.5755 mL	27.1510 mL	67.8776 mL
	5 mM	0.5430 mL	2.7151 mL	5.4302 mL	13.5755 mL
	10 mM	0.2715 mL	1.3576 mL	2.7151 mL	6.7878 mL
	15 mM	0.1810 mL	0.9050 mL	1.8101 mL	4.5252 mL
	20 mM	0.1358 mL	0.6788 mL	1.3576 mL	3.3939 mL
	25 mM	0.1086 mL	0.5430 mL	1.0860 mL	2.7151 mL
	30 mM	0.0905 mL	0.4525 mL	0.9050 mL	2.2626 mL
	40 mM	0.0679 mL	0.3394 mL	0.6788 mL	1.6969 mL
	50 mM	0.0543 mL	0.2715 mL	0.5430 mL	1.3576 mL
	60 mM	0.0453 mL	0.2263 mL	0.4525 mL	1.1313 mL
	80 mM	0.0339 mL	0.1697 mL	0.3394 mL	0.8485 mL
	100 mM	0.0272 mL	0.1358 mL	0.2715 mL	0.6788 mL